

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

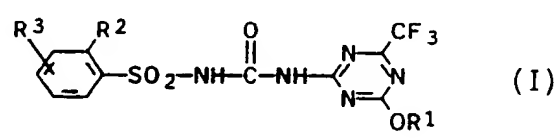
**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



**PCT**  
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>5</sup> : <b>C07D 521/00, 251/16</b> <b>A01N 47/36</b>		<b>A1</b>	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 92/09608</b> (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: <b>11. Juni 1992 (11.06.92)</b>
(21) Internationales Aktenzeichen: <b>PCT/EP91/02192</b> (22) Internationales Anmeldedatum: <b>21. November 1991 (21.11.91)</b> (30) Prioritätsdaten: <b>P 40 38 430.6</b> <b>1. Dezember 1990 (01.12.90)</b> <b>DE</b> (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigshafen (DE).</b> (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US) : <b>MAYER, Horst [DE/DE]; Faselwiese 19, D-6700 Ludwigshafen (DE). HAMP-RECHT, Gerhard [DE/DE]; Rote-Turm-Strasse 28, D-6940 Weinheim (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-6720 Speyer (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Gruenstadter Strasse 82, D-6719 Ob- righeim (DE). GERBER, Matthias [DE/DE]; Ritter- strasse 3, D-6704 Mutterstadt (DE). GROSSMANN, Klaus [DE/DE]; Wilhelm-Busch-Strasse 5, D-6703 Lim- burgerhof (DE). RADEMACHER, Wilhelm [DE/DE]; Au- strasse 1, D-6703 Limburgerhof (DE).</b>		(74) Gemeinsamer Vertreter: <b>BASF AKTIENGESELL- SCHAFT; Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigsha- fen (DE).</b> (81) Bestimmungsstaaten: <b>AT (europäisches Patent), BE (euro- päisches Patent), BR, CA, CH (europäisches Patent), DE (europäisches Patent), DK (europäisches Patent), ES (europäisches Patent), FR (europäisches Patent), GB (europäisches Patent), GR (europäisches Patent), HU, IT (europäisches Patent), JP, KR, LU (europäisches Pa- tent), NL (europäisches Patent), SE (europäisches Pa- tent), SU*, US.</b>  <b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i>	

(54) Title: **HERBICIDAL N-[(1,3,5-TRIAZINE-2-YL)AMINOCARBONYL]BENZOLE SULPHONAMIDES**  
(54) Bezeichnung: **HERBIZIDE N-[(1,3,5-TRIAZIN-2-YL)AMINOCARBONYL]BENZOLSULFONAMIDE**



(57) Abstract  
N-[(1,3,5-triazine-2-yl)aminocarbonyl]benzolesulphonamides of general formula (I) in which: R<sup>1</sup> is a methyl or ethyl group, R<sup>2</sup> is halogen, a C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl sulphonyl group, the trifluoromethyl group or 2-methoxy ethoxy group and R<sup>3</sup> is hydrogen, the methyl, ethyl methoxy or ethoxy group, fluorine or chlorine, and their agriculturally usable salts, process for their production and their use.

(57) Zusammenfassung  
N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide der allgemeinen Formel (I), in der R<sup>1</sup> eine Methyl- oder Ethylgruppe, R<sup>2</sup> Halogen, eine C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylsulfonylgruppe, die Trifluormethylgruppe oder 2-Methoxyethoxygruppe und R<sup>3</sup> Wasserstoff, die Methyl-, Ethyl-, Methoxy- oder Ethoxygruppe, Fluor oder Chlor bedeuten, sowie deren landwirtschaftlich brauchbare Salze, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung.

# + BESTIMMUNGEN DER "SU"

Die Bestimmung der "SU" hat Wirkung in der Russischen Föderation. Es ist noch nicht bekannt, ob solche Bestimmungen in anderen Staaten der ehemaligen Sowjetunion Wirkung haben.

## LEDIGLICH ZUR INFORMATION

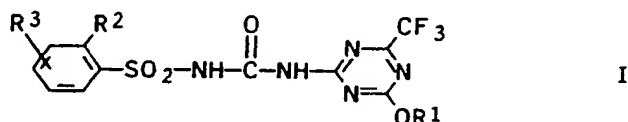
Code, die zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AT	Österreich	ES	Spanien	ML	Mali
AU	Australien	FI	Finnland	MN	Mongolei
BB	Barbados	FR	Frankreich	MR	Mauritanien
BE	Belgien	GA	Gabon	MW	Malawi
BF	Burkina Faso	GB	Vereinigtes Königreich	NL	Niederlande
BG	Bulgarien	GN	Guinea	NO	Norwegen
BJ	Benin	GR	Griechenland	PL	Polen
BR	Brasilien	HU	Ungarn	RO	Rumänien
CA	Kanada	IT	Italien	SD	Sudan
CF	Zentrale Afrikanische Republik	JP	Japan	SE	Schweden
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SN	Senegal
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SU <sup>+</sup>	Soviet Union
CI	Côte d'Ivoire	LI	Liechtenstein	TD	Tschad
CM	Kamerun	LK	Sri Lanka	TG	Togo
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	US	Vereinigte Staaten von Amerika
DE	Deutschland	MC	Monaco		
DK	Dänemark	MG	Madagaskar		

Herbizide N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide

# Beschreibung

- 5 Die vorliegende Erfindung betrifft N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)-aminocarbonyl]benzolsulfonamide der allgemeinen Formel I

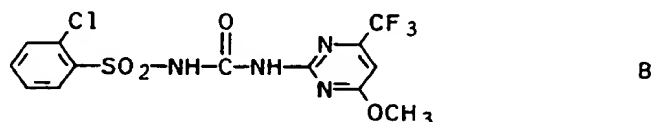
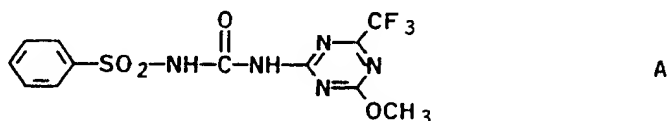


- 10 in der R<sup>1</sup> eine Methyl- oder Ethylgruppe, R<sup>2</sup> Halogen, eine C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylsulfonylgruppe, die Trifluormethylgruppe oder die 2-Methoxyethoxygruppe, und R<sup>3</sup> Wasserstoff, die Methyl-, Ethyl-, Methoxy- oder Ethoxygruppe, Fluor oder Chlor bedeuten, sowie deren landwirtschaftlich brauchbare Salze.

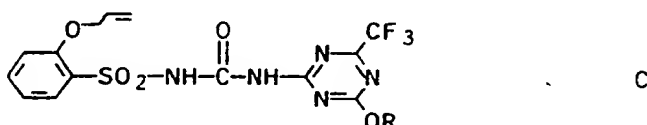
- 15 Des weiteren betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I sowie ihre Verwendung als herbizide Mittel.

- 20 Die US-Patente 4 120 691 und 4 127 405 und die EP-A 44 807 betreffen Sulfonylharnstoffe mit herbizider Wirkung deren allgemeine Formel die eingangs definierten Verbindungen der allgemeinen Formel I umfaßt.

- 25 In der US 4 120 691 sind als nächstliegende Strukturen die Triazinverbindung A sowie das Pyrimidin-Derivat B beschrieben.

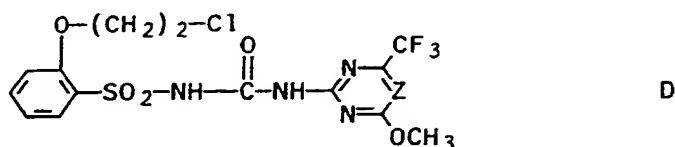


In der EP-A 44 807 sind zwei Sulfonylharnstoffe C mit einer ortho-ständigen Allyloxygruppe beschrieben.



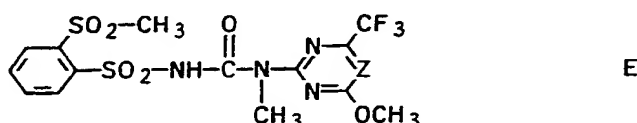
R=CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

In der EP-A 48 808 sind zwei Sulfonylharnstoffe D mit einer 2-Chlorethoxysubstitution im Aromatenteil beschrieben.



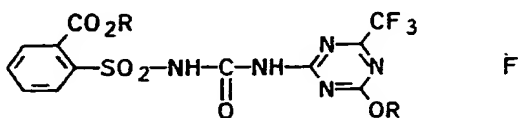
Z = CH, N

5 In der EP-A 48 143 sind zwei N-methylierte Sulfonylharnstoffe E ohne nähere Charakterisierung aufgeführt.



Z = CH, N

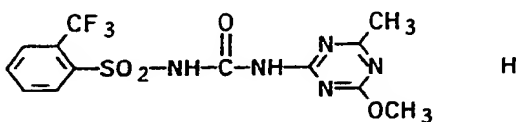
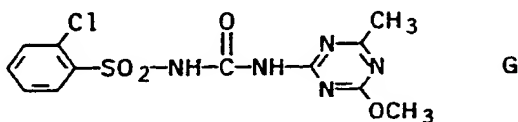
Die EP-A 388 873 umfaßt Benzoessäureester der Struktur F.



R = CH3, C2H5

Das US-Patent 4 127 405 offenbart Sulfonylharnstoffderivate mit Chlor- bzw. Trifluormethylsubstitution in ortho-Stellung des Phenylrings und CH3/OCH3-Substitution im Triazinring

10



Die Verbindung G ist unter der Bezeichnung Chlorsulfuron (Glean®) bekannt.

15 Der Erfindung lag nun die Aufgabe zugrunde, Sulfonylharnstoffe zu synthetisieren, die gegenüber den bekannten Vertretern dieser Herbizid-Klasse verbesserte Eigenschaften aufweisen und sich insbesondere durch hohe Selektivität in empfindlichen Kulturen wie Reis oder Mais auszeichnen.

Entsprechend dieser Aufgabe wurden die eingangs definierten N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide der Formel I gefunden.

- 5 In der Formel I bedeutet C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylsulfonyl eine Methyl-, Ethyl-, Propyl- oder Isopropylsulfonylgruppe, Halogen steht für Fluor, Chlor, Brom oder Jod, insbesondere Fluor oder Chlor. Besonders bevorzugt sind Benzolsulfonamide, in den R<sup>2</sup> für Chlor steht.

10

Die erfindungsgemäßen Sulfonylharnstoffe der Formel I sind auf verschiedenen Wegen zugänglich, die in der Literatur beschrieben sind. Beispielhaft seien besonders vorteilhafte Wege (A-D) im folgenden näher erläutert.

15

20

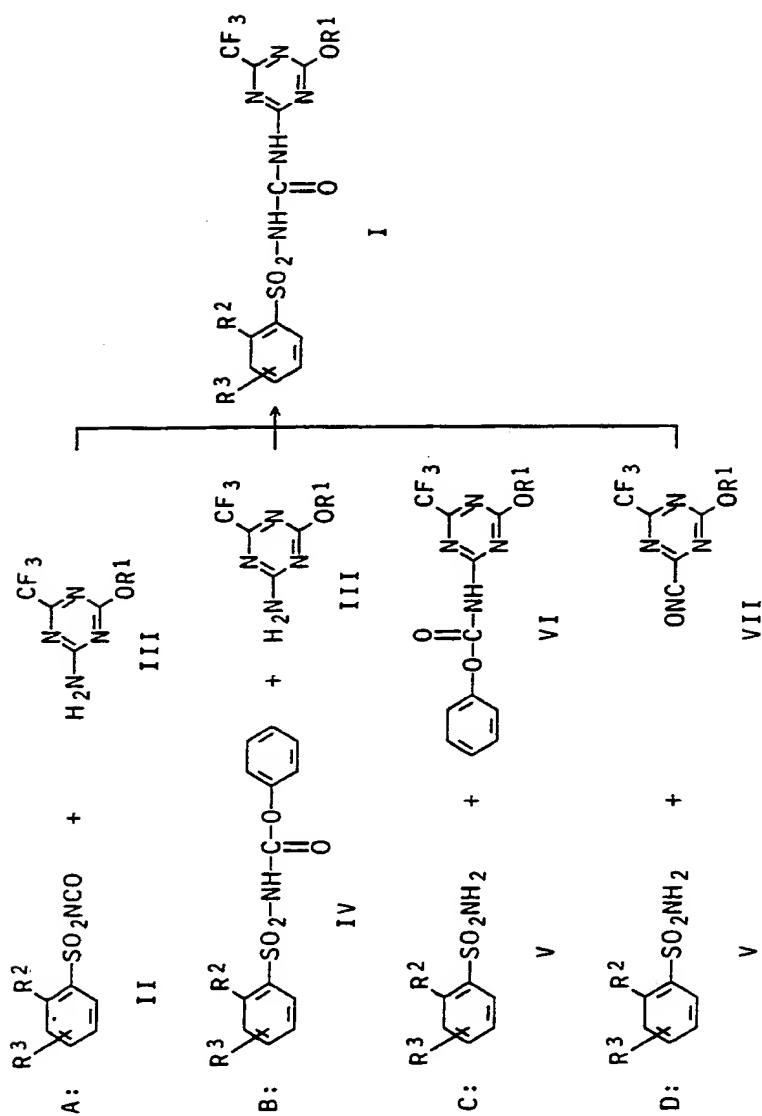
25

30

35

40

4





- A: Man setzt ein Sulfonylisocyanat II in an sich bekannter Weise (EP-A-162 723) mit ungefähr der stöchiometrischen Menge eines 2-Amino-1,3,5-triazin-derivats III bei einer Temperatur von 0 bis 120°C, vorzugsweise 10 bis 100°C um.
- 5 Die Reaktion kann unter Normaldruck oder unter Druck (bis 50 bar), vorzugsweise bei 1 bis 5 bar, kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt werden.
- 10 Zweckmäßigerweise verwendet man für die Umsetzungen unter den jeweiligen Reaktionsbedingungen inerte Lösungs- und Verdünnungsmittel. Als Lösungsmittel kommen beispielsweise Halogenkohlenwasserstoffe, insbesondere Chlorkohlenwasser-
- 15 stoffe, z.B. Tetrachlorethylen, 1,1,2,2- oder 1,1,1,2-Tetrachlorethan, Dichlorpropan, Methylenchlorid, Dichlorbutan, Chloroform, Chlornaphthalin, Dichlornaphthalin, Tetrachlor-
- 20 kohlenstoff, 1,1,1- oder 1,1,2-Trichlorethan, Trichlorethylen, Pentachlorethan, o-, m-, p-Difluorbenzol, 1,2-Dichlorethan, 1,1-Dichlorethan, 1,2-cis-Dichlorethylen, Chlorbenzol, Fluorbenzol, Brom-
- 25 benzol, Jodbenzol, o-, m-, p-Dichlorbenzol, o-, p-, m-Dibrombenzol, o-, m-, p-Chlortoluol, 1,2,4-Trichlorbenzol; Ether, z.B. Ethylpropylether, Methyl-tert.-butylether, n-Butylethylether, Di-n-butylether, Diisobutylether, Diiso-
- 30 amylether, Diisopropylether, Anisol, Phenetol, Cyclohexylmethylether, Diethylether, Ethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Thioanisol,  $\beta,\beta'$ -Dichlordiethylether;
- 35 Nitrokohlenwasserstoffe wie Nitromethan, Nitroethan, Nitrobenzol, o-, m-, p-Chlornitrobenzol, o-Nitrotoluol; Nitrile wie Acetonitril, Butyronitril, Isobutyronitril, Benzonitril, m-Chlorbenzonitril; aliphatische oder cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Heptan, Pinan, Nonan, o-, m-,
- 40 p-Cymol, Benzinfraktionen innerhalb eines Siedepunktintervalles von 70 bis 190°C, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Dekalin, Petrolether, Hexan, Ligroin, 2,2,4-Trimethylpentan, 2,2,3-Trimethylpentan, 2,3,3-Trimethylpentan, Octan; Ester, z.B. Ethylacetat, Acetessigester, Isobutylacetat; Amide, z.B. Formamid, Methylformamid, Dimethylformamid; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon und entsprechende Gemische in Betracht. Zweckmäßig verwendet man das Lösungsmittel in einer Menge von 100 bis 2000 Gew.%, vorzugsweise von 200 bis 700 Gew.%, bezogen auf den Ausgangsstoff II.

Die zur Umsetzung benötigte Verbindung II wird im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen (mit einem Über- oder Unterschub von z.B. 0 bis 20 %, bezogen auf den jeweiligen Ausgangsstoff III) eingesetzt. Man kann den Ausgangsstoff III in einem der vorgenannten Verdünnungsmittel vorlegen und dann den Ausgangsstoff II zugeben.

Zweckmäßigerweise wird das Verfahren zur Herstellung der neuen Verbindungen jedoch so durchgeführt, daß man den Ausgangsstoff II, gegebenenfalls in einem der vorgenannten Verdünnungsmittel, vorlegt und dann den Ausgangsstoff III zugibt.

Zur Beendigung der Umsetzung rührt man nach der Zugabe der Komponenten noch 20 Minuten bis 24 Stunden bei 0 bis 120°C, vorzugsweise 10 bis 100°C, nach.

Als Reaktionsbeschleuniger kann man vorteilhafterweise ein tertiäres Amin, z.B. Pyridin,  $\alpha,\beta,\gamma$ -Picolin, 2,4-, 2,6-Lutidin, 2,4,6-Collidin, p-Dimethylaminopyridin, Trimethylamin, Triethylamin, Tri(n-propyl)amin, 1,4-Diaza[2,2,2]bicyclooctan [DABCO] oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en in einer Menge von 0.01 bis 1 Mol pro Mol Ausgangsstoff II verwenden.

Aus dem Reaktionsgemisch wird der Endstoff I in üblicher Weise, z.B. nach Abdestillieren von Lösungsmittel oder direkt durch Absaugen isoliert. Der verbleibende Rückstand kann noch mit Wasser bzw. verdünnter Säure zur Entfernung basischer Verunreinigungen gewaschen werden. Man kann jedoch auch den Rückstand in einem mit Wasser nicht mischbaren Lösungsmittel lösen und wie beschrieben waschen. Die gewünschten Endstoffe fallen hierbei in reiner Form an, gegebenenfalls können sie durch Umkristallisation, Rühren in einem organischen Lösungsmittel, das die Verunreinigungen aufnimmt oder Chromatographie gereinigt werden.

Bevorzugt führt man diese Umsetzung in Acetonitril, Methyl-tert.-butylether, Toluol oder Methylenchlorid in Anwesenheit von 0 bis 100 Moläquivalenten, vorzugsweise 0 bis 50 Moläquivalenten eines tertiärenamins wie 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]octan oder Triethylamin durch.

- 5 B: Man setzt ein entsprechendes Sulfonylcarbamat der Formel IV in an sich bekannter Weise (EP-A-120 814, EP-A-101 407) in einem inerten organischen Lösungsmittel bei einer Temperatur zwischen 0 und 120°C, vorzugsweise 10 bis 100°C mit einem 2-Amino-1,3,5-triazin-derivat III um. Es können hierbei Basen wie tertiäre Amine zugesetzt werden, wodurch die Reaktion beschleunigt und die Produktqualität verbessert wird.
- 10 Geeignete Basen hierfür sind z.B. tertiäre Amine wie unter A angegeben, insbesondere Triethylamin oder 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]octan, in einer Menge von 0,01 bis 1 mol pro Mol Ausgangsstoff IV.
- 15 Zweckmäßig verwendet man als Lösungsmittel die unter A angegebenen.
- 20 Man verwendet das Lösungsmittel in einer Menge von 100 bis 2.000 Gew.%, vorzugsweise von 200 bis 700 Gew.%, bezogen auf den Ausgangsstoff IV.
- 25 Die zur Umsetzung benötigte Verbindung IV wird im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen (mit einem Über- oder Unterschuß von z.B. 0 bis 20 %, bezogen auf jeweiligen Ausgangsstoff III eingesetzt. Man kann den Ausgangsstoff IV in einem der vorgenannten Verdünnungsmittel vorlegen und dann den Ausgangsstoff III zugeben.
- 30 Man kann jedoch auch den Ausgangsstoff III in einem der genannten Löse- oder Verdünnungsmittel vorlegen und das Sulfonylcarbamat IV zugeben.
- 35 In beiden Fällen kann als Katalysator vor oder während der Reaktion eine Base zugesetzt werden.
- Aus dem Reaktionsgemisch kann das Endprodukt I in üblicher Weise, wie unter A angegeben, gewonnen werden.
- 40 C: Man setzt ein Sulfonamid der Formel V in an sich bekannter Weise (EP-A-141 777 und EP-A-101 670) in einem inerten organischen Lösungsmittel mit ungefähr der stöchiometrischen Menge eines Phenylcarbamats VI bei einer Temperatur von 0

bis 120°C, vorzugsweise 20 bis 100°C um. Die Reaktion kann bei Normaldruck oder unter Druck (bis 50 bar), vorzugsweise bei 1 bis 5 bar, kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt werden.

5

Es können hierbei Basen wie tertiäre Amine zugesetzt werden, die die Reaktion beschleunigen und die Produktqualität verbessern. Geeignete Basen sind hierfür die unter A angegebenen, insbesondere Triethylamin, 2,4,6-Collidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]octan [DABCO] oder 1,8-Diazabicyclo-

10

[5,4,0]undec-7-en (DBU), in einer Menge von 0,01 bis 1 mol pro Mol Ausgangsstoff V.

Zweckmäßigerweise verwendet man als Löse- oder Verdünnungsmittel die unter A angegebenen.

15

Man verwendet das Lösungsmittel in einer Menge von 100 bis 2000 Gew.%, vorzugsweise von 200 bis 700 Gew.%, bezogen auf das Edukt V.

20

Die zur Umsetzung benötigte Verbindung V wird im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen (mit einem Über- oder Unterschub von z.B. 0 bis 20 %, bezogen auf die jeweiligen Ausgangsstoffe VI) eingesetzt. Man kann den Ausgangsstoff VI in

25

einem der vorgenannten Verdünnungsmittel vorlegen und dann den Ausgangsstoff V zugeben.

Man kann jedoch auch den Ausgangsstoff V in einem der genannten Lösungsmittel vorlegen und dann das Carbamat VI zugeben. In beiden Fällen kann als Katalysator vor oder während der Reaktion eine der genannten Basen zugesetzt werden.

30

Zur Beendigung der Umsetzung rührt man nach der Zugabe der Komponenten noch 20 Minuten bis 24 Stunden bei 0 bis 120°C, vorzugsweise 10 bis 100°C, insbesondere 20 bis 80°C, nach.

35

Man isoliert die Sulfonylharnstoffe der Formel I aus dem Reaktionsgemisch mit den üblichen Methoden, wie unter A beschrieben.

40

- 5 D: Man setzt ein Sulfonamid der Formel V in an sich bekannter Weise (EP-A-234 352) in einem inerten organischen Lösungsmittel mit ungefähr der stöchiometrischen Menge eines Isocyanates VII zu einer Temperatur von 0 bis 150°C, vorzugsweise 10 bis 100°C um. Die Reaktion kann bei Normaldruck oder unter Druck (bis 50 bar), vorzugsweise bei 1 bis 5 bar, kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt werden.
- 10 Es können hierbei vor oder während der Reaktion Basen wie tertiäre Amine zugesetzt werden, die die Reaktion beschleunigen und die Produktqualität verbessern. Geeignete Basen sind hierfür die unter A angegebenen, insbesondere Triethylamin oder 2,4,6-Collidin, in einer Menge von 0,01 bis 1 mol pro Mol Ausgangsstoff V.
- 15 Zweckmäßigerweise verwendet man als Lösungsmittel die unter A angegebenen. Man setzt das Lösungsmittel in einer Menge von 100 bis 2000 Gew.%, vorzugsweise von 200 bis 700 Gew.%, bezogen auf das Edukt V.
- 20 Die zur Umsetzung benötigte Verbindung V wird im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen (mit einem Über- oder Unterschuß von z.B. 0 bis 20 %, bezogen auf die Edukte VII) eingesetzt. Man kann den Ausgangsstoff VII in einem der genannten
- 25 Verdünnungsmittel vorlegen und dann den Ausgangsstoff V zugeben. Man kann aber auch das Sulfonamid vorlegen und dann das Isocyanat VII zugeben.
- 30 Zur Beendigung der Umsetzung rührt man nach der Zugabe der Komponenten noch 20 Minuten bis 24 Stunden bei 0 bis 120°C, vorzugsweise 10 bis 100°C, insbesondere 20 bis 80°C, nach. Das Endprodukt I kann aus dem Reaktionsgemisch in der üblichen Weise, wie unter A: beschrieben, gewonnen werden.
- 35 Die als Ausgangsstoffe benötigten Sulfonylisocyanate der Formel II lassen sich in an sich bekannter Weise aus den entsprechenden Sulfonamiden durch Phosgenierung (Houben-Weyl 11/2 (1985) 1106, US 4 379 769) oder durch Umsetzung der Sulfonamide mit Chlorsulfonylisocyanat (DE-OS 3 132 944) gewinnen.

40

Die Sulfonylcarbamate der Formel IV wurden nach oder in Analogie zu an sich bekannten Reaktionen (z.B. EP-A 120 814) hergestellt. Man kann aber auch die Sulfonylisocyanate der Formel II in glatter Reaktion in einem inerten Lösungsmittel wie Ether oder  
5 Dichlormethan mit Phenol in die Carbamate der Formel IV überführen.

Carbamate der Formel VI sind nach oder in Analogie zu bekannten Umsetzungen (z.B. EP-A 101 670) zugänglich, sie lassen sich aber  
10 auch aus den entsprechenden Isocyanaten VII durch Umsetzung mit Phenol herstellen.

Die Isocyanate der Formel VII erhält man aus den Aminen der Formel III durch Behandlung mit Oxalylchlorid oder Phosgen (in  
15 Analogie nach Angew. Chem. 83 (1971) 407, EP-A 388 873).

Die Sulfonamide lassen sich durch Reaktion der entsprechenden Sulfonsäurechloride mit Ammoniak gewinnen (Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Band 9 (1955) 605). Die Sulfonsäure-  
20 chloride erhält man entweder durch Meerwein-Reaktion (Diazo-  
tierung geeigneter Amine und Kupfersalz-katalysierte Sulfo-  
chlorierung) oder durch Chlorsulfonierung geeigneter Aromaten  
beispielsweise 2,5-Dichlorbenzolsulfonsäurechlorid aus  
p-Dichlorbenzol (Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie,  
25 Band 9 (1955) 557 ff.).

2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin und 2-Amino-4-  
ethoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin sind literaturbekannt  
(Yakugaku Zasshi 95 (1975) 499).  
30

Die Salze der Verbindungen I sind in an sich bekannter Weise zugänglich (EP-A-304 282, US-A 4,599,412). Man erhält sie durch Deprotonierung der entsprechenden Sulfonylharnstoffe I in Wasser oder einem inerten organischen Lösungsmittel bei Temperaturen  
35 von -80°C bis 120°C, vorzugsweise 0°C bis 60°C in Gegenwart einer Base.

Geeignete Basen sind beispielsweise Alkali- oder Erdalkali-  
metallhydroxide, -hydride, -oxide oder -alkoholate wie Natrium-,  
40 Kalium- und Lithiumhydroxid, Natriummethanolat, -ethanolat und  
-tert.-butanolat, Natrium- und Calciumhydrid und Calciumoxid.

Als Lösungsmittel kommen beispielsweise neben Wasser auch Alkohole wie Methanol, Ethanol und tert.-Butanol, Ether wie Tetrahydrofuran und Dioxan, Acetonitril, Dimethylformamid, Ketone wie Aceton und Methylethylketon und auch halogenierte Kohlenwasserstoffe in Betracht.

Die Deprotonierung kann bei Normaldruck oder bei Drucken bis 50 bar, vorzugsweise bei Normaldruck bis 5 bar Überdruck durchgeführt werden.

Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel sowie deren umweltverträgliche Salze von Alkalimetallen und Erdalkalimetallen können in Kulturen wie Weizen, Reis und Mais Schadpflanzen sehr gut bekämpfen, ohne die Kulturpflanzen zu schädigen, ein Effekt, der vor allem auch bei niedrigen Aufwandsmengen auftritt. Sie können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen I eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen. Als inerte Zusatzstoffe kommen u.a. Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel, wie N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die

- Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und
- 5 eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-,
- 10 Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate
- 15 mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxy-ethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl-aryl-polyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen-
- 20 oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkyl-ether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

- 25 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunst-
- 30 stoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

- 40 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.%, Wirkstoff.



Beispiele für Formulierungen sind:

- 5 I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.
- 10 II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch 15 Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- 20 III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch 25 Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- 30 IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch 35 Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

40

- 5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40
- V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.
- VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykoether, 2 Gewichtsteilen Natrium Salz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- Die Applikation kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).
- Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 1,0 kg/ha, vorzugsweise 0,01 bis 0,5 kg/ha.

- In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen
- 5 beispielsweise folgende Kulturen:

	Botanischer Name	Deutscher Name
	<i>Allium cepa</i>	Küchenzwiebel
	<i>Ananas comosus</i>	Ananas
10	<i>Arachis hypogaea</i>	Erdnuß
	<i>Asparagus officinalis</i>	Spargel
	<i>Beta vulgaris</i> spp. <i>altissima</i>	Zuckerrübe
	<i>Beta vulgaris</i> spp. <i>rapa</i>	Futterrübe
	<i>Brassica napus</i> var. <i>napus</i>	Raps
15	<i>Brassica napus</i> var. <i>napobrassica</i>	Kohlrübe
	<i>Brassica rapa</i> var. <i>silvestris</i>	Rübsen
	<i>Camellia sinensis</i>	Teestrauch
	<i>Carthamus tinctorius</i>	Saflor - Färberdistel
	<i>Citrus limon</i>	Zitrone
20	<i>Citrus sinensis</i>	Apfelsine, Orange
	<i>Coffea arabica</i> ( <i>Coffea canephora</i> , <i>Coffea liberica</i> )	Kaffee
	<i>Cucumis sativus</i>	Gurke
	<i>Cynodon dactylon</i>	Bermudagrass
25	<i>Daucus carota</i>	Möhre
	<i>Elaeis guineensis</i>	Ölpalme
	<i>Fragaria vesca</i>	Erdbeere
	<i>Glycine max</i>	Sojabohne
30	<i>Gossypium hirsutum</i> ( <i>Gossypium arboreum</i> , <i>Gossypium herbaceum</i> , <i>Gossypium vitifolium</i> )	Baumwolle
	<i>Helianthus annuus</i>	Sonnenblume
	<i>Hevea brasiliensis</i>	Parakautschukbaum
	<i>Hordeum vulgare</i>	Gerste
	<i>Humulus lupulus</i>	Hopfen
35	<i>Ipomoea batatas</i>	Süßkartoffeln
	<i>Juglans regia</i>	Walnußbaum
	<i>Lens culinaris</i>	Linse
	<i>Linum usitatissimum</i>	Faserlein
	<i>Lycopersicon lycopersicum</i>	Tomate
40	<i>Malus</i> spp.	Apfel
	<i>Manihot esculenta</i>	Maniok
	<i>Medicago sativa</i>	Luzerne

	Botanischer Name	Deutscher Name
	Musa spp.	Obst- und Mehlbanane
	Nicotiana tabacum (N. rustica)	Tabak
	Olea europaea	Ölbaum
5	Oryza sativa	Reis
	Phaseolus lunatus	Mondbohne
	Phaseolus vulgaris	Buschbohnen
	Picea abies	Rotfichte
	Pinus spp.	Kiefer
10	Pisum sativum	Gartenerbse
	Prunus avium	Süßkirsche
	Prunus persica	Pfirsich
	Pyrus communis	Birne
	Ribes sylvestre	Rote Johannisbeere
15	Ribes uva-crispa	Stachelbeere
	Ricinus communis	Rizinus
	Saccharum officinarum	Zuckerrohr
	Secale cereale	Roggen
	Solanum tuberosum	Kartoffel
20	Sorghum bicolor (S. vulgare)	Mohrenhirse
	Theobroma cacao	Kakaobaum
	Trifolium pratense	Rotklee
	Triticum aestivum	Weizen
	Triticum durum	Hartweizen
25	Vicia faba	Pferdebohnen
	Vitis vinifera	Weinrebe
	Zea mays	Mais

- 30 Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Triazinyl-substituierten Sulfonylharnstoffe der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3,1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Phenyl-oxy- bzw. Heteroaryloxy-phenylpropionsäuren sowie deren Salze, 40 Ester und Amide und andere in Betracht.

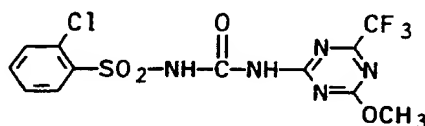
Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

10

Nachstehend sind Beispiele für die Synthese der Verbindungen I wiedergegeben.

- 1) 2-Chlor-1-N-[4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamid

15



Eine Lösung aus 4,0 g (21 mmol) 2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin in 20 ml Acetonitril wurde bei 25°C mit 4,5 g (21 mmol) 2-Chlorbenzolsulfonylisocyanat versetzt. Die so erhaltene Lösung wurde 21 Stunden bei 25°C gerührt. Das Lösungsmittel wurde dann unter vermindertem Druck bei 40°C entfernt und der feste Rückstand mit 1 l eines Diethylether-/Hexan-Gemisches (v:v 1/1) 3 h kräftig gerührt. Das Produkt wurde abgesaugt und im Vakuum bei 40°C getrocknet. Man erhielt 6,5 g (75 % d.Th.) der Titelverbindung mit Fp. 166 - 168°C.

20

25

- 2) Natrium[2-chlor-1-N-[(4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamid]

30

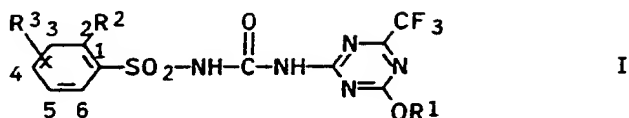
Eine Suspension von 1,5 g (3,6 mmol) 2-Chlor-1-[(4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamid in 10 ml Methylenchlorid wurde bei 25°C mit 0,66 g (3,6 mmol) einer Lösung von Natriummethanolat (30 gew.-prozentig) in Methanol versetzt. Die sich bildende homogene Lösung wurde 1 h bei 25°C gerührt. Nach Entfernen der flüchtigen Anteile bei 60°C im Wasserstrahlvakuum erhielt man die Titelverbindung in quantitativer Ausbeute mit Zersetzungspunkt 220 - 224°C.

35

Die in der nachfolgenden Tabelle 1 genannten Wirkstoffe werden auf analogem Herstellungsweg erhalten.

Tabelle 1

5

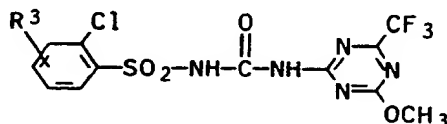


Wirkstoff					
	Nr.	R1	R2	R3	Fp [°C]
10	1	CH <sub>3</sub>	Cl	H	166-168
	2	CH <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	108-110
	3	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	164-169
	4	CH <sub>3</sub>	Cl	H	220-224 (Zers.) Na-Salz
	5	CH <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	119 (Zers.) Na-Salz
	6	CH <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	139 (Zers.) Ca-Salz
	7	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	165 (Zers.) Na-Salz
15	8	CH <sub>3</sub>	Cl	6-Cl	168
	9	CH <sub>3</sub>	Cl	H	160-163 (Zers.) Ca-Salz
	10	CH <sub>3</sub>	Cl	H	232 (Zers.) K-Salz
	11	CH <sub>3</sub>	Cl	6-CH <sub>3</sub>	140-144
	12	CH <sub>3</sub>	Cl	5-Cl	151-156
20	13	CH <sub>3</sub>	F	H	162-164
	14	CH <sub>3</sub>	Br	H	156-160
	15	CH <sub>3</sub>	J	H	
	16	CH <sub>3</sub>	F	H	>220 (Zers.) Na-Salz
25	17	CH <sub>3</sub>	F	H	>220 (Zers.) K-Salz
	18	CH <sub>3</sub>	F	H	>220 (Zers.) Ca-Salz
	19	CH <sub>3</sub>	F	6-F	177-180
	20	CH <sub>3</sub>	F	6-F	180-200 (Zers.) Na-Salz
	21	CH <sub>3</sub>	F	6-F	>220 (Zers.) K-Salz
30	22	CH <sub>3</sub>	F	6-F	155-159 (Zers.) Ca-Salz
	23	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	3-Cl	155-157
	24	CH <sub>3</sub>	Cl	3-Cl	175-177
	25	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	3-Cl	197-200 (Zers.) Na-Salz
	26	CH <sub>3</sub>	Cl	3-Cl	198-201 (Zers.) Na-Salz
35	27	CH <sub>3</sub>	Cl	6-CH <sub>3</sub>	175-178 (Zers.) Na-Salz
	28	CH <sub>3</sub>	Cl	6-CH <sub>3</sub>	180-183 K-Salz
	29	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	176-177
	30	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	186-188 Na-Salz

Tabelle 1 (Fortsetzung)

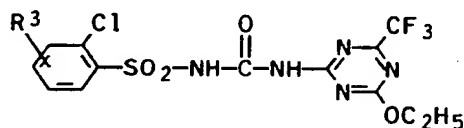
Wirkstoff					
	Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
5	31	CH <sub>3</sub>	Cl	3-Cl	>220 (Zers.) K-Salz
	32	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	164-165
	33	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	149-151
	34	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	149-150
	35	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	200 (Zers.) Na-Salz
10	36	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	211 (Zers.) Ca-Salz
	37	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	152-155
	38	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	181-182
	39	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	173-177

- 15 In analoger Weise können auch die nachfolgend aufgeführten Verbindungen erhalten werden:



oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

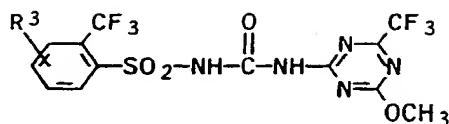
- 20 Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;



- 25 oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

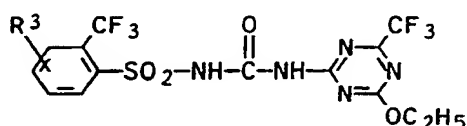
- Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;

- 30



oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

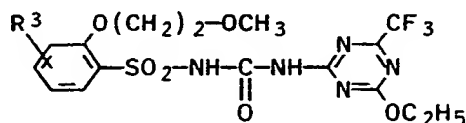
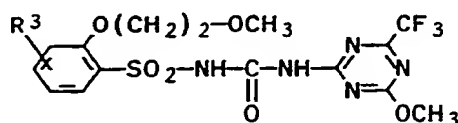
- Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor,  
 5 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;



oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

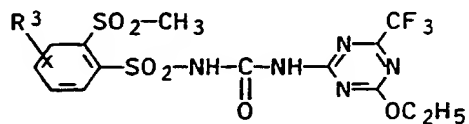
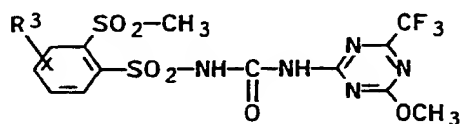
- 10 Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;

15



oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

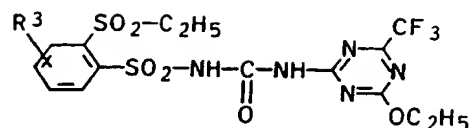
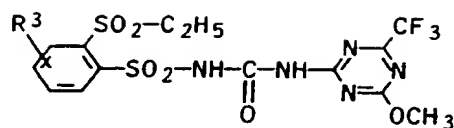
- Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor,  
 20 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;



oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

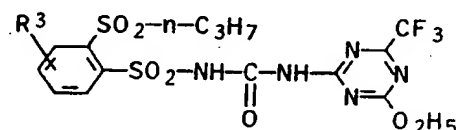
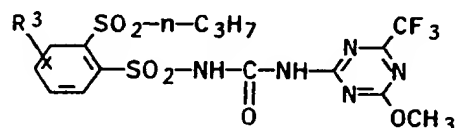
- 25 Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;





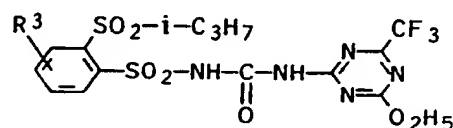
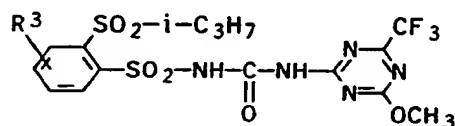
oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

- Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;



oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

- Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy;



- 15 oder deren Na-Salze, wobei R<sup>3</sup> die folgende Bedeutung hat:

Wasserstoff, 3-Methyl, 4-Methyl, 5-Methyl, 6-Methyl, 3-Ethyl, 4-Ethyl, 5-Ethyl, 6-Ethyl, 3-Fluor, 4-Fluor, 5-Fluor, 6-Fluor, 3-Chlor, 4-Chlor, 5-Chlor, 6-Chlor, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 5-Methoxy, 6-Methoxy, 3-Ethoxy, 4-Ethoxy, 5-Ethoxy, 6-Ethoxy.

#### Anwendungsbeispiele:

- Die herbizide Wirkung der N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]-benzolsulfonamide der Formel I auf das Wachstum der Testpflanzen wird durch folgende Gewächshausversuche gezeigt.

- Als Kulturgefäße dienen Plastikblumentöpfe mit 300 cm<sup>3</sup> Inhalt und lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen werden nach Arten getrennt flach eingesät.

5 Zum Zwecke der Nachauflaufbehandlung werden entweder direkt gesäte oder in den gleichen Gefäßen aufgewachsene Pflanzen ausgewählt oder sie werden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.

10 Je nach Wuchsform werden die Testpflanzen bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm dann mit den in Wasser als Verteilungsmittel suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen, die durch fein verteilende Düsen gespritzt werden, behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung beträgt 0,06 bzw. 0,03 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

15 Die Versuchsgefäße werden im Gewächshaus aufgestellt, wobei für wärmeliebende Arten wärmere Bereiche (20 bis 35°C) und für solche gemäßigter Klimate 10 bis 20°C bevorzugt werden. Die Versuchsperiode erstreckt sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit werden die Pflanzen gepflegt und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wird ausgewertet.

20 Bewertet wird nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

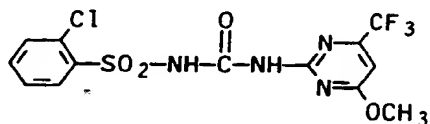
25 Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzen sich aus folgenden Arten zusammen:

	Lateinischer Name	Deutscher Name
30	<i>Amaranthus retroflexus</i>	Zurückgekrümmter Fuchsschwanz
	<i>Chenopodium album</i>	Weißer Gänsefuß
	<i>Chrysanthemum</i>	Kronenwucherblume
	<i>Galium aparine</i>	Klettenlabkraut
35	<i>Stellaria media</i>	Vogelmiere
	<i>Triticum aestivum</i>	Sommerweizen
	<i>Zea mays</i>	Mais

40 Mit 0,06 bzw. 0,03 kg/ha a.S. im Nachauflaufverfahren eingesetzt lassen sich mit Beispiel Nr. 1 breitblättrige unerwünschte Pflanzen sehr gut bekämpfen, bei gleichzeitiger hervorragender Selektivität in den Kulturpflanzen Weizen und Mais.

In der folgenden Tabelle sind Ergebnisse aus biologischen Untersuchungen zusammengestellt, in denen der erfindungsgemäße Wirkstoff Beispiel 1 mit der aus U.S. 4,169,719 bekannten Verbindung B verglichen wurde.

5



B

Tabelle 1: Vergleich der herbiziden Aktivität der Beispielverbindung Nr. 1 mit der Vergleichsverbindung B bei Nachauflaufanwendung von 0,06 bzw. 0,03 kg/ha a.S. im Gewächshaus

10 Testpflanzen

Schädigung [%]

Aufwandmenge [kg/ha a.S.]

Beispiel 1

B

0,06

0,03

0,06

0,03

Amaranthus retroflexus

100

100

0

0

15 Galium aparine

95

90

0

0

Chenopodium album

90

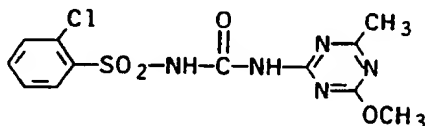
90

0

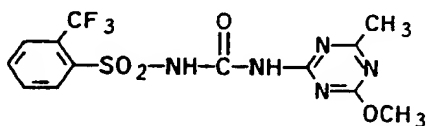
0

In den Tabellen 2 und 3 werden die erfindungsgemäßen Verbindungen der Beispiele 1 bzw. 3 den aus dem US-Patent 4 127 405

20 bekannten Vergleichssubstanzen G bzw. H gegenübergestellt.



G



H

Die Versuchsergebnisse demonstrieren deutlich die überraschend hohen Selektivitäten.

25 Die bekannten Verbindungen bewirken nicht akzeptable Schädigungen von 85 bzw. 70 % in der Kultur Mais. Demgegenüber zeigen die Beispielverbindungen 1 bzw. 3 bei gleich guter bis besserer herbizider Wirkung nur noch 10 % Schädigung der Kulturpflanze.

Tabelle 2: Vergleich der herbiziden Aktivität der Beispielverbindung Nr. 1 mit der Vergleichsverbindung G bei Nachauflaufanwendung von 0,03 kg/ha a.S. im Gewächshaus

5	Testpflanzen	Schädigung [%]	
		Beispiel 1	G
	Zea mays	10	85
	unerwünschte Pflanzen:		
	Amaranthus retroflexus	90	90
10	Galium aparine	80	74

Tabelle 3: Vergleich der herbiziden Aktivität der Beispielverbindung Nr. 3 mit der Vergleichsverbindung H bei Nachauflaufanwendung von 0,06 bzw. 0,03 kg/ha a.S. im Gewächshaus

15	Testpflanzen	Schädigung [%]			
		Aufwandmenge [kg/ha a.S.]			
		Beispiel 3		H	
		0,06	0,03	0,06	0,03
20	Zea mays	10	10	70	70
	unerwünschte Pflanzen:				
	Amaranthus retroflexus	90	90	90	90
	Galium aparine	95	60	10	0
	Chenopodium album	98	98	98	98
25	Sinapis alba	95	90	90	90

Hervorragende Selektivitäten in den empfindlichen Beispielkulturen Reis, Sommerweizen und Mais werden durch die erfindungsgemäße Verbindung Nr. 7 erzielt, wie die in den nachfolgenden Tabellen 4 und 5 zusammengestellten Ergebnisse zeigen.

Tabelle 4: Bekämpfung unerwünschter breitblättriger Pflanzen bei gleichzeitiger Verträglichkeit für die Beispielkulturen Sommerweizen und Mais bei Nachauflaufapplikation von 0,015 kg a.S./ha der Verbindung Nr. 7 im Gewächshaus

40	Testpflanzen	Schädigung [%]
	Triticum aestivum	10
	Zea mays	15
	unerwünschte Pflanzen:	
	Amaranthus retroflexus	90
	Chenopodium album	75
	Stellaria media	100

Tabelle 5: Bekämpfung unerwünschter breitblättriger Pflanzen bei gleichzeitiger Verträglichkeit für die Beispielkultur Reis bei Nachauflaufapplikation von 0,015 kg a.S./ha der Verbindung Nr. 7 im Gewächshaus

5

	Testpflanzen	Schädigung [%]
	Oryza sativa	10
	unerwünschte Pflanzen	
	Amaranthus retroflexus	95
10	Sinapis alba	70
	Stellaria media	100

In einem weiteren Versuch wurde das Natriumsalz der Vergleichs-  
 verbindung H dem Beispiel 7 gegenübergestellt. Die Ergebnisse  
 15 sind in Tabelle 6 zusammengestellt.

Tabelle 6: Vergleich der herbiziden Aktivität der Beispieler-  
 bindung Nr. 7 mit dem Natriumsalz der Vergleichsverbindung H bei  
 Nachauflaufenanwendung von 0,06 bzw. 0,03 kg/ha a.S. im Gewächs-  
 20 haus

	Testpflanzen	Schädigung [%]			
		Aufwandmenge [kg/ha a.S.]			
		Beispiel 7		H-Na-Salz	
25		0,06	0,03	0,06	0,03
	Zea mays	10	0	100	100
	unerwünschte Pflanzen:				
	Amaranthus retroflexus	100	100	90	90
	Galium aparine	98	98	70	60
30	Chenopodium album	100	100	100	100

Die Versuchsergebnisse demonstrieren deutlich die überraschend  
 hohe Selektivität bei gleichzeitig hervorragender herbizider  
 Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Verbindung.

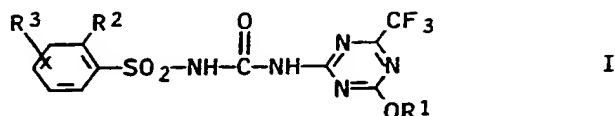
35

40

## Patentansprüche

1. N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide der allgemeinen Formel I

5



in der R<sup>1</sup> eine Methyl- oder Ethylgruppe, R<sup>2</sup> Halogen, eine C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylsulfonylgruppe, die Trifluormethylgruppe oder 2-Methoxyethoxygruppe und R<sup>3</sup> Wasserstoff, die Methyl-, Ethyl-, Methoxy- oder Ethoxygruppe, Fluor oder Chlor bedeuten, sowie deren landwirtschaftlich brauchbare Salze.

10

2. N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide der Formel I gemäß Anspruch 1, in der R<sup>2</sup> Chlor bedeutet.

- 15 3. Verfahren zur Herstellung der N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Sulfonylisocyanat II



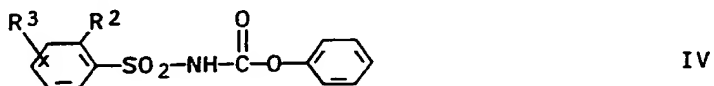
in an sich bekannter Weise in einem inerten organischen Lösungsmittel mit der ungefähr stöchiometrischen Menge eines 2-Amino-1,3,5-triazin-derivats III

20



umsetzt.

- 25 4. Verfahren zur Herstellung der N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamide der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbamat der Formel IV

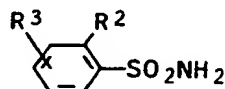


in an sich bekannter Weise in einem inerten organischen Lösungsmittel bei einer Temperatur zwischen 0 und 120°C mit ungefähr der stöchiometrischen Menge eines 2-Amino-1,3,5-triazins III umgesetzt.

5

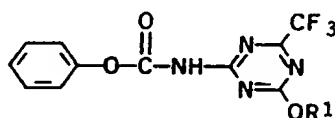
5. Verfahren zur Herstellung der N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)amino-carbonyl]benzolsulfonamide der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein entsprechendes Sulfonamid der Formel V

10



V

in an sich bekannter Weise in einem inerten organischen Lösungsmittel mit einem Phenylcarbammat VI



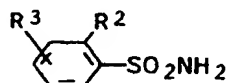
VI

umsetzt.

15

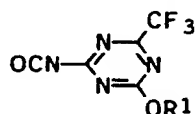
6. Verfahren zur Herstellung der N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)amino-carbonyl]benzolsulfonamide der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein entsprechendes Sulfonamid der Formel V

20



V

in an sich bekannter Weise in einem inerten organischen Lösungsmittel mit einem Isocyanat der Formel VII



VII

umsetzt.

25

7. Verfahren zur Herstellung von Salzen der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 in an sich bekannter Weise in Wasser oder einem inerten organischen Lösungsmittel mit einer Base deprotoniert.

30

8. Herbizides Mittel, enthaltend ein N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)-aminocarbonyl]benzolsulfonamid der Formel I gemäß Anspruch 1 oder sein Salz sowie hierfür übliche Trägerstoffe.
- 5 9. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge eines N-[(1,3,5-Triazin-2-yl)aminocarbonyl]benzolsulfonamids der Formel I gemäß Anspruch 1 oder eines seiner Salze auf die Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
- 10 10. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 als herbizide Mittel.
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No PCT/EP91/02192

<b>I. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> (If several classification symbols apply, indicate all) *		
According to International Patent Classification (IPC) or to both National Classification and IPC		
Int.Cl.5	C07D 521/00	C07D 251/16 A01N 47/36
<b>II. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum Documentation Searched *		
Classification System	Classification Symbols	
Int.Cl.5	C07D	
Documentation Searched other than Minimum Documentation to the Extent that such Documents are Included in the Fields Searched *		
<b>III. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT *</b>		
Category *	Citation of Document, <sup>11</sup> with indication, where appropriate, of the relevant passages <sup>12</sup>	Relevant to Claim No. <sup>13</sup>
A	EP, A, 0388873 (BASF AG) 26 September 1990 see claims 1-9 (cited in the application)	1-10
Y	EP, A, 0048143 (E.I. DU PONT DE NEMOURS & CO.) 24 March 1982; see claims 1,19-21; table II (cited in the application)	1,8-10
Y	EP, A, 0044807 (CIBA-GEIGY AG) 27 January 1982 see compounds 576,578; claims 1,29-33 (cited in the application)	1,8-10
A	EP, A, 0044808 (CIBA-GEIGY AG) 27 January 1982 see compounds 161,163,346,348,400; claims 1,38-42 (cited in the application)	1,8-10
Y	US, A, 4169719 (G. LEVITT) 2 October 1979 see columns 77,78; claims 1,28; tables I-E (cited in the application)	1,8-10
Y	US, A, 4127405 (G. LEVITT) 28 November 1978 see claims 1,27 (cited in the application)	1,8-10
-----		
<div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div style="width: 48%;"> <p>* Special categories of cited documents: <sup>10</sup></p> <p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> </div> <div style="width: 48%;"> <p>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step</p> <p>"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</p> <p>"&amp;" document member of the same patent family</p> </div> </div>		
<b>IV. CERTIFICATION</b>		
Date of the Actual Completion of the International Search	Date of Mailing of this International Search Report	
17 February 1992 (17.02.92)	24 March 1992 (24.03.92)	
International Searching Authority	Signature of Authorized Officer	
Patent European Office		

**ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT  
ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.**

EP 9102192

SA 53245

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on 13/03/92. The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information.

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A- 0388873	26-09-90	DE-A- 3909146	18-10-90
		AU-B- 617044	14-11-91
		AU-A- 5147990	27-09-90
		CA-A- 2011987	21-09-90
		JP-A- 2279679	15-11-90
		US-A- 5071470	10-12-91
EP-A- 0048143	24-03-82	US-A- 4371391	01-02-83
		AU-A- 7522681	25-03-82
		CA-A- 1167847	22-05-84
		JP-A- 57081471	21-05-82
EP-A- 0044807	27-01-82	CH-A- 657849	30-09-86
		AT-T- E4526	15-09-83
		AU-B- 545208	04-07-85
		CA-C- 1205482	03-06-86
		EP-A, B 0044808	27-01-82
		EP-A, B 0044809	27-01-82
		US-A- 4510325	09-04-85
		US-A- 4476321	09-10-84
		US-A- 4419121	06-12-83
		US-A- 4514212	30-04-85
		US-A- 4444583	24-04-84
		US-A- 4561878	31-12-85
		US-A- 4537619	27-08-85
		US-A- 4479821	30-10-84
		US-A- 4425154	10-01-84
		US-A- 4629810	16-12-86
		US-A- 4681619	21-07-87
		AU-B- 570734	24-03-88
		AU-A- 3421784	07-02-85
		AU-A- 7303681	21-01-82
		JP-C- 1442692	08-06-88
		JP-A- 57056452	05-04-82
		JP-B- 62045228	25-09-87
		JP-C- 1591517	30-11-90
		JP-B- 2014347	06-04-90
		JP-A- 62116554	28-05-87
		SU-A- 1289390	07-02-87

# ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.

EP 9102192

SA 53245

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on 13/03/92. The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information.

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A- 0044808	27-01-82	CH-A- 657849	30-09-86
		AT-T- E4526	15-09-83
		AU-B- 545208	04-07-85
		CA-C- 1205482	03-06-86
		EP-A, B 0044807	27-01-82
		EP-A, B 0044809	27-01-82
		US-A- 4510325	09-04-85
		US-A- 4476321	09-10-84
		US-A- 4419121	06-12-83
		US-A- 4514212	30-04-85
		US-A- 4444583	24-04-84
		US-A- 4561878	31-12-85
		US-A- 4537619	27-08-85
		US-A- 4479821	30-10-84
		US-A- 4425154	10-01-84
		US-A- 4629810	16-12-86
		US-A- 4681619	21-07-87
		AU-B- 570734	24-03-88
		AU-A- 3421784	07-02-85
		AU-A- 7303681	21-01-82
		JP-C- 1442692	08-06-88
		JP-A- 57056452	05-04-82
		JP-B- 62045228	25-09-87
		JP-C- 1591517	30-11-90
		JP-B- 2014347	06-04-90
		JP-A- 62116554	28-05-87
		SU-A- 1289390	07-02-87
US-A- 4169719	02-10-79	AT-B- 357359	10-07-80
		AU-B- 511370	14-08-80
		AU-A- 2406577	12-10-78
		AU-B- 510056	05-06-80
		AU-A- 2406677	12-10-78
		BE-A- 853374	07-10-77
		CA-A- 1082189	22-07-80
		CH-A- 632643	29-10-82
		DE-A, C 2715786	13-10-77
		FR-A, B 2403337	13-04-79
		GB-A- 1561120	13-02-80

EPO FORM P079

For more details about this annex : see Official Journal of the European Patent Office, No. 12/82

# ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.

EP 9102192

SA 53245

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on 13/03/92. The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information.

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US-A- 4169719		GB-A- 1560918	13-02-80
		JP-C- 1426354	25-02-88
		JP-A- 52122384	14-10-77
		JP-B- 62036029	05-08-87
		LU-A- 77081	01-12-77
		NL-A- 7703809	11-10-77
		OA-A- 5625	30-04-81
		SE-B- 436742	21-01-85
		SE-A- 7704035	08-10-77
		SU-A- 860675	30-08-81
		SU-A- 860676	30-08-81
		SU-A- 1435141	30-10-88
		US-A- 4127405	28-11-78
		US-A- 4120691	17-10-78
US-A- 4127405	28-11-78	AT-B- 357359	10-07-80
		AU-B- 511370	14-08-80
		AU-A- 2406577	12-10-78
		AU-B- 510056	05-06-80
		AU-A- 2406677	12-10-78
		BE-A- 853374	07-10-77
		CA-A- 1082189	22-07-80
		CH-A- 632643	29-10-82
		DE-A, C 2715786	13-10-77
		FR-A, B 2403337	13-04-79
		GB-A- 1561120	13-02-80
		GB-A- 1560918	13-02-80
		JP-C- 1426354	25-02-88
		JP-A- 52122384	14-10-77
		JP-B- 62036029	05-08-87
		LU-A- 77081	01-12-77
		NL-A- 7703809	11-10-77
		OA-A- 5625	30-04-81
		SE-B- 436742	21-01-85
		SE-A- 7704035	08-10-77
		SU-A- 860675	30-08-81
		SU-A- 860676	30-08-81
		SU-A- 1435141	30-10-88
		US-A- 4120691	17-10-78



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 91/02192

## I. KLASSIFIKATION DES ANMELDUNGSGEGENSTANDS (bei mehreren Klassifikationssymbolen sind alle anzugeben)<sup>6</sup>

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

Int.C1.5                      C 07 D 521/00                      C 07 D 251/16                      A 01 N 47/36

## II. RECHERCHIERTE SACHGEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff <sup>7</sup>

Klassifikationssystem

Klassifikationssymbole

Int.C1.5

C 07 D

Recherchierte nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Sachgebiete fallen <sup>8</sup>

## III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN <sup>9</sup>

Art. <sup>10</sup>	Kennzeichnung der Veröffentlichung <sup>11</sup> , soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile <sup>12</sup>	Betr. Anspruch Nr. <sup>13</sup>
A	EP,A,0388873 (BASF AG) 26. September 1990, siehe Ansprüche 1-9 (In der Anmeldung erwähnt) ---	1-10
Y	EP,A,0048143 (E.I. DU PONT DE NEMOURS & CO.) 24. März 1982, siehe Ansprüche 1,19-21; Tabelle II (In der Anmeldung erwähnt) ---	1,8-10
Y	EP,A,0044807 (CIBA-GEIGY AG) 27. Januar 1982, siehe Verbindungen 576,578; Ansprüche 1,29-33 (In der Anmeldung erwähnt) ---	1,8-10
A	EP,A,0044808 (CIBA-GEIGY AG) 27. Januar 1982, siehe Verbindungen 161,163,346,348,400; Ansprüche 1,38-42 (In der Anmeldung erwähnt) --- -/-	1,8-10

<sup>9</sup> Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen <sup>10</sup>:

- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

## IV. BESCHEINIGUNG

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

17-02-1992

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

24. 03. 92

Internationale Recherchenbehörde

EUROPAISCHES PATENTAMT

Unterschrift des Bevollmächtigten/Bediensteten

*[Handwritten Signature]*  
K. B. L. 10000000

## III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN (Fortsetzung von Blatt 2)

Art °	Kennzeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	US,A,4169719 (G. LEVITT) 2. Oktober 1979, siehe Spalten 77,78; Ansprüche 1,28; Tabellen I-E (In der Anmeldung erwähnt) ---	1,8-10
Y	US,A,4127405 (G. LEVITT) 28. November 1978, siehe Ansprüche 1,27 (In der Anmeldung erwähnt) -----	1,8-10

# ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.

EP 9102192  
SA 53245

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.  
Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 13/03/92  
Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A- 0388873	26-09-90	DE-A- 3909146	18-10-90
		AU-B- 617044	14-11-91
		AU-A- 5147990	27-09-90
		CA-A- 2011987	21-09-90
		JP-A- 2279679	15-11-90
		US-A- 5071470	10-12-91
EP-A- 0048143	24-03-82	US-A- 4371391	01-02-83
		AU-A- 7522681	25-03-82
		CA-A- 1167847	22-05-84
		JP-A- 57081471	21-05-82
EP-A- 0044807	27-01-82	CH-A- 657849	30-09-86
		AT-T- E4526	15-09-83
		AU-B- 545208	04-07-85
		CA-C- 1205482	03-06-86
		EP-A, B 0044808	27-01-82
		EP-A, B 0044809	27-01-82
		US-A- 4510325	09-04-85
		US-A- 4476321	09-10-84
		US-A- 4419121	06-12-83
		US-A- 4514212	30-04-85
		US-A- 4444583	24-04-84
		US-A- 4561878	31-12-85
		US-A- 4537619	27-08-85
		US-A- 4479821	30-10-84
		US-A- 4425154	10-01-84
		US-A- 4629810	16-12-86
		US-A- 4681619	21-07-87
		AU-B- 570734	24-03-88
		AU-A- 3421784	07-02-85
		AU-A- 7303681	21-01-82
		JP-C- 1442692	08-06-88
		JP-A- 57056452	05-04-82
		JP-B- 62045228	25-09-87
		JP-C- 1591517	30-11-90
		JP-B- 2014347	06-04-90
		JP-A- 62116554	28-05-87
		SU-A- 1289390	07-02-87

EPO FORM 19473

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82



# ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.

EP 9102192

SA 53245

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentedokumente angegeben.  
Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 13/03/92  
Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A- 0044808	27-01-82	CH-A- 657849	30-09-86
		AT-T- E4526	15-09-83
		AU-B- 545208	04-07-85
		CA-C- 1205482	03-06-86
		EP-A, B 0044807	27-01-82
		EP-A, B 0044809	27-01-82
		US-A- 4510325	09-04-85
		US-A- 4476321	09-10-84
		US-A- 4419121	06-12-83
		US-A- 4514212	30-04-85
		US-A- 4444583	24-04-84
		US-A- 4561878	31-12-85
		US-A- 4537619	27-08-85
		US-A- 4479821	30-10-84
		US-A- 4425154	10-01-84
		US-A- 4629810	16-12-86
		US-A- 4681619	21-07-87
		AU-B- 570734	24-03-88
		AU-A- 3421784	07-02-85
		AU-A- 7303681	21-01-82
		JP-C- 1442692	08-06-88
		JP-A- 57056452	05-04-82
		JP-B- 62045228	25-09-87
		JP-C- 1591517	30-11-90
		JP-B- 2014347	06-04-90
		JP-A- 62116554	28-05-87
		SU-A- 1289390	07-02-87
US-A- 4169719	02-10-79	AT-B- 357359	10-07-80
		AU-B- 511370	14-08-80
		AU-A- 2406577	12-10-78
		AU-B- 510056	05-06-80
		AU-A- 2406677	12-10-78
		BE-A- 853374	07-10-77
		CA-A- 1082189	22-07-80
		CH-A- 632643	29-10-82
		DE-A, C 2715786	13-10-77
		FR-A, B 2403337	13-04-79
		GB-A- 1561120	13-02-80

EPO FORM P0473

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82

# ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.

EP 9102192  
SA 53245

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentedokumente angegeben.  
Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 13/03/92  
Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US-A- 4169719		GB-A- 1560918	13-02-80
		JP-C- 1426354	25-02-88
		JP-A- 52122384	14-10-77
		JP-B- 62036029	05-08-87
		LU-A- 77081	01-12-77
		NL-A- 7703809	11-10-77
		OA-A- 5625	30-04-81
		SE-B- 436742	21-01-85
		SE-A- 7704035	08-10-77
		SU-A- 860675	30-08-81
		SU-A- 860676	30-08-81
		SU-A- 1435141	30-10-88
		US-A- 4127405	28-11-78
		US-A- 4120691	17-10-78
US-A- 4127405	28-11-78	AT-B- 357359	10-07-80
		AU-B- 511370	14-08-80
		AU-A- 2406577	12-10-78
		AU-B- 510056	05-06-80
		AU-A- 2406677	12-10-78
		BE-A- 853374	07-10-77
		CA-A- 1082189	22-07-80
		CH-A- 632643	29-10-82
		DE-A, C 2715786	13-10-77
		FR-A, B 2403337	13-04-79
		GB-A- 1561120	13-02-80
		GB-A- 1560918	13-02-80
		JP-C- 1426354	25-02-88
		JP-A- 52122384	14-10-77
		JP-B- 62036029	05-08-87
		LU-A- 77081	01-12-77
		NL-A- 7703809	11-10-77
		OA-A- 5625	30-04-81
		SE-B- 436742	21-01-85
		SE-A- 7704035	08-10-77
		SU-A- 860675	30-08-81
		SU-A- 860676	30-08-81
		SU-A- 1435141	30-10-88
		US-A- 4120691	17-10-78

EPO FORM P0471

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82

## ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.

EP 9102192  
SA 53245

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.

Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 13/03/92.  
Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US-A- 4127405		US-A- 4169719	02-10-79
-----			

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**